

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE

An:

siehe Formular PCT/ISA/220

PCT

**SCHRIFTLICHER BESCHIED DER
INTERNATIONALEN
RECHERCHENBEHÖRDE
(Regel 43bis.1 PCT)**

Absenddatum
(Tag/Monat/Jahr) siehe Formular PCT/ISA/210 (Blatt 2)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts
siehe Formular PCT/ISA/220

WEITERES VORGEHEN
siehe Punkt 2 unten

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000643

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)
24.01.2005

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
30.01.2004

Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK
C07D317A4, C07D49108, C07D20952

Anmelder
LONZA AG

1. Dieser Bescheid enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids
- ☐ Feld Nr. II Priorität
- ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- ☒ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43bis.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- ☐ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen
- ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- ☒ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

2. **WEITERES VORGEHEN**

Wird ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung gestellt, so gilt dieser Bescheid als schriftlicher Bescheid der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde ("IPEA"); dies trifft nicht zu, wenn der Anmelder eine andere Behörde als diese als IPEA wählt und die gewählte IPEA dem Internationalen Büro nach Regel 66.1bis b) mitgeteilt hat, daß schriftliche Bescheide dieser Internationalen Recherchenbehörde nicht anerkannt werden.

Wenn dieser Bescheid wie oben vorgesehen als schriftlicher Bescheid der IPEA gilt, so ist der Anmelder aufgefordert, bei der IPEA vor Ablauf von 3 Monaten ab dem Tag, an dem das Formblatt PCT/ISA/220 abgesandt wurde oder vor Ablauf von 22 Monaten ab dem Prioritätsdatum, je nachdem, welche Frist später abläuft, eine schriftliche Stellungnahme und, wo dies angebracht ist, Änderungen einzureichen.

Weitere Optionen siehe Formblatt PCT/ISA/220.

3. Nähere Einzelheiten siehe die Anmerkungen zu Formblatt PCT/ISA/220.

Name und Postanschrift der mit der internationalen
Recherchenbehörde



Europäisches Patentamt
D-80298 München
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Bevollmächtigter Bediensteter

Stroeter, T

Tel. +49 89 2399-8088



**SCHRIFTLICHER BESCHEID DER
INTERNATIONALEN RECHERCHEBEHÖRDE**

10/584848
IP20 Rec'd PCT/PTO 28 JUN 2006
Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000643

Feld Nr. 1 Grundlage des Bescheids

1. Hinsichtlich der **Sprache** ist der Bescheid auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache erstellt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - ☐ Der Bescheid ist auf der Grundlage einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache erstellt worden, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (gemäß Regeln 12.3 und 23.1 b)).
2. Hinsichtlich der **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz**, die in der internationalen Anmeldung offenbart wurde und für die beanspruchte Erfindung erforderlich ist, ist der Bescheid auf folgender Grundlage erstellt worden:
 - a. Art des Materials
 - ☐ Sequenzprotokoll
 - ☐ Tabelle(n) zum Sequenzprotokoll
 - b. Form des Materials
 - ☐ in schriftlicher Form
 - ☐ in computerlesbarer Form
 - c. Zeitpunkt der Einreichung
 - ☐ in der eingereichten internationalen Anmeldung enthalten
 - ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht
 - ☐ bei der Behörde nachträglich für die Zwecke der Recherche eingereicht
3. ☐ Wurden mehr als eine Version oder Kopie eines Sequenzprotokolls und/oder einer dazugehörigen Tabelle eingereicht, so sind zusätzlich die erforderlichen Erklärungen, daß die Information in den nachgereichten oder zusätzlichen Kopien mit der Information in der Anmeldung in der eingereichten Fassung übereinstimmt bzw. nicht über sie hinausgeht, vorgelegt worden.
4. Zusätzliche Bemerkungen:

**SCHRIFTLICHER BESCHEID DER
INTERNATIONALEN RECHERCHEBEHÖRDE**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000643

Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1. ☒ Auf die Aufforderung zur Zahlung zusätzlicher Gebühren (Formblatt PCT/ISA/206) hat der Anmelder:
- ☐ zusätzliche Gebühren entrichtet.
 - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
 - ☒ keine zusätzlichen Gebühren entrichtet.
2. ☐ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat beschlossen, den Anmelder nicht zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Meinung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung gemäß Regel 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist.
 - ☒ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:
siehe Beiblatt
4. Daher ist der Bescheid für die folgenden Teile der internationalen Anmeldung erstellt worden:
- ☐ alle Teile
 - ☒ die Teile, die sich auf die Ansprüche mit folgenden Nummern beziehen: 1-14(teilweise), 15-17(komplett)

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43b/s.1(a)(I) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit	Ja: Ansprüche 1-17 Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit	Ja: Ansprüche Nein: Ansprüche 1-17
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ja: Ansprüche: 1-17 Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

**SCHRIFTLICHER BESCHEID DER
INTERNATIONALEN RECHERCHEBEHÖRDE**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000643

Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:

siehe Beiblatt

Zu Punkt IV

Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

Die vorliegende Anmeldung befasst sich mit einem Verfahren zur Herstellung von 4-substituierter 2,3-Isopropylidendioxocyclopentan-1-aminen der Formel I sowie Salze dieser Verbindungen mit zwei- oder dreibasigen organischen Säuren. Die vorliegenden Ansprüche 1-14 sind dabei sowohl auf die freien Amine wie auch die Salze ausgerichtet.

Es ergeben sich zwei Gruppen von Erfindungen:

1. Ansprüche 1-14 (teilweise), 15-17 (ganz):

Verfahren (Schritte a) bis e)) und Intermediate zur Herstellung von freien 4-substituierten 2,3-Isopropylidendioxocyclopentan-1-aminen der Formel I

2. Ansprüche 1-14 (teilweise), 18 (ganz)

Salze von 4-substituierten 2,3-Isopropylidendioxocyclopentan-1-aminen der Formel I mit zwei- oder dreibasigen organischen Säuren und Verfahren (Schritt f)) zu ihrer Herstellung

Eine Europäische Patentanmeldung darf nur eine einzige Erfindung bzw. eine Gruppe von Erfindungen, welche durch ein gemeinsames erfinderisches Konzept verbunden sind, enthalten (Regel 13.1 PCT). Einheitlichkeit liegt nur dann vor, wenn ein technischer Zusammenhang zwischen den Erfindungen besteht, der in einem oder mehreren besonderen technischen Merkmalen zum Ausdruck kommt. Unter "besondere technische Merkmale" sind diejenigen technischen Merkmale zu verstehen, die einen Beitrag der beanspruchten Erfindung zum Stand der Technik bestimmen (Regel 13.2 PCT).

Der Gegenstand beider Erfindungsgruppen beinhaltet die freien 4-substituierten 2,3-Isopropylidendioxocyclopentan-1-amine als das einzige gemeinsame Merkmal. Besagte Verbindungen gehören aber bereits zum Stand der Technik (z.B. D1, D2) und stellen daher kein "besonderes technisches Merkmal" dar. Entsprechend sind die beiden genannten Gruppen auf zwei unterschiedliche Problemstellungen ausgerichtet und somit auf zwei unterschiedliche Erfindungen:

**SCHRIFTLICHER BESCHEID
DER INTERNATIONALEN
RECHERCHEBEHÖRDE (BEIBLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/000643

- Gruppe 1: Alternativprozess zur Darstellung von freien 4-substituierten 2,3-Isopropylidendioxocyclopentan-1-aminen ausgehend von bekannten Aza-Bicyclen
- Gruppe 2: Darstellung weiterer Salze zwei- oder dreibasigen organischen Säuren ausgehend von bekannten freien 4-substituierten 2,3-Isopropylidendioxocyclopentan-1-aminen

Im folgenden wird die weitere Prüfung auf Basis derjenigen Erfindung durchgeführt, für die ein Recherchebericht vorliegt, demnach Erfindung (1).

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- 1 Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen. Die angegebene Numerierung der Dokumente wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

- D1: O 02/091988 A (AVENTIS PHARMA INC) 21. November 2002
D2: WO 00/23447 A (MYERS MICHAEL R ; CHOI SLEDESKI YONG MI (US); PAULS HEINZ W (US); EWIN) 27. April 2000
D3: WO 97/03053 A (RHONE POULENC RORER PHARMA ; PETRE DOMINIQUE (FR); DARNAND ELIANE (FR)) 30. Januar 1997
D4: US-A-5 684 159 (LARGEAU DENIS ET AL) 4. November 1997
D5: WO 00/03032 A (BRUX FRANK ; GUGGISBERG YVES (CH); LONZA AG (CH); WERBITZKY OLEG (CH);) 20. Januar 2000

- 2 In den relevantesten Dokumenten zum Stand der Technik D1 bzw. D2 sind vergleichbaren Syntheserouten zu der vorliegenden Route II -> III -> IV -> V -> I

offenbart. Das vorliegende Verfahren stellt eine neue Auswahl aus dem nächstliegenden Verfahren von D1 dar, indem die allgemeine Schutzgruppe P angeführt ist, aber Acetyl als Schutzgruppe nicht spezifisch erwähnt wird. Beispielhaft erwähnt ist die Schutzgruppe BOC. Der Gegenstand der Erfindung 1 ist demnach neu (Art. 33(2) PCT).

- 3 Die vorliegende technische Aufgabe besteht in der Bereitstellung eines alternativen Verfahrens zur Darstellung bekannter, freier 4-substituierter 2,3-Isopropylidendioxocyclopentan-1-amine, ausgehend von bekannten Aza-Bicyclen. Die Lösung liegt in der Anwendung einer bestimmten Schutzgruppe (Ac) in einem ansonsten gleichen, mehrstufigen Verfahren. Die Auswahl einer bestimmten Schutzgruppe ohne einen dadurch erreichten vorteilhaften überraschenden Effekt im Vergleich mit dem naheliegendsten Stand der Technik (D1, Bsp. 3) ist nicht als erfinderische Auswahl zu bezeichnen. Demnach sind derzeit die Ansprüche der Erfindung 1 nicht als erfinderisch zu bezeichnen (Art. 33(3) PCT).
- 4 Die vorliegenden Ansprüche sind gewerblich anwendbar und erfüllen die Erfordernisse des Art. 33(4) PCT.

Zu Punkt VIII

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Das in der vorliegenden Anmeldung beispielhaft ausgeführte Verfahren zur Darstellung von Verbindungen der Formel I mit $R^2 = R^3 = \text{Me}$ ist nicht von den Ansprüchen umfasst. Demnach sind die vorliegenden Ansprüche nicht im Sinne von Artikel 6 PCT auf die Beschreibung gestützt und im Sinne von Artikel 5 PCT in der Patentanmeldung offenbart.